

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005年6月9日 (09.06.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/051912 A1(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07D 211/46, 211/38, 211/54, 211/56  
// A61K 31/451, A61P 43/00, 29/00, 37/08, 25/06, 17/04,  
25/18, 25/16, 25/24, 25/22, 25/36, 25/28, 1/04, 9/12, 9/10,  
7/02, 25/00, 17/06, 19/10, 27/02, 27/16, 37/02(74) 代理人: 津国 肇 (TSUKUNI, Hajime); 〒1050001 東京  
都港区虎ノ門1丁目2番12号 SVAX TSB  
ビル Tokyo (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/017543

(22) 国際出願日: 2004年11月26日 (26.11.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願 2003-398368  
2003年11月28日 (28.11.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 田辺製  
薬株式会社 (TANABE SEIYAKU CO., LTD.) [JP/JP];  
〒5418505 大阪府大阪市中央区道修町3丁目2番  
10号 Osaka (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 高橋 政巳 (TAKA-  
HASHI, Masami). 三宅 努 (MIYAKE, Tsutomu). 山  
中 武志 (YAMANAKA, Takeshi). 浅井 秀敏 (ASAI,  
Hidetoshi). 河野 理夏子 (KONO, Rikako).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可  
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,  
CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE,  
IS, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI  
(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE,  
SN, TD, TG).

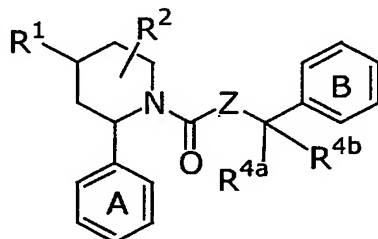
添付公開書類:

— 国際調査報告書

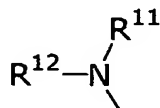
2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PIPERIDINE COMPOUND AND METHOD FOR PRODUCING SAME

(54) 発明の名称: ピペリジン化合物およびその製法



[ I ]



[ II ]

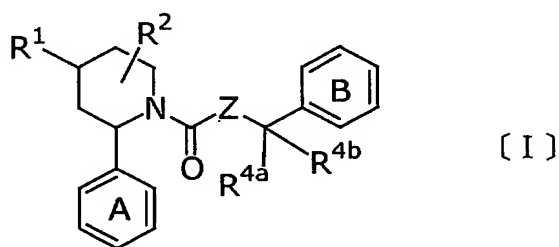
(57) Abstract: Disclosed are a novel piperidine compound  
represented by the general formula [I] below which has an excellent  
tachykinin receptor antagonizing activity and pharmacologically  
acceptable salts thereof. [I] In the formula, ring A represents an  
optionally substituted benzene ring; ring B represents an optionally  
substituted benzene ring; R<sup>1</sup> represents an optionally substituted  
hydroxyl group, a thiol group having a substituent, a sulfonyl  
group having a substituent, or a group represented by the following  
formula [II]: wherein R<sup>11</sup> represents a carbonyl group having  
a substituent or a sulfonyl group having a substituent and R<sup>12</sup>  
represents a hydrogen atom or an optionally substituted alkyl group;  
R<sup>2</sup> represents a hydrogen atom or the like; Z represents an oxygen  
atom or a group represented by -N(R<sup>3</sup>)- wherein R<sup>3</sup> represents an  
optionally substituted alkyl group or the like; R<sup>4a</sup> represents an  
optionally substituted alkyl group; and R<sup>4b</sup> represents an optionally  
substituted alkyl group.

[続葉有]

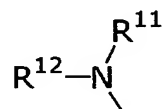
(57) 要約:

【要約】

本発明は、一般式〔I〕:



式中、環Aは置換基を有していてもよいベンゼン環を表し、環Bは置換基を有していてもよいベンゼン環を表し、 $R^1$ は置換基を有していてもよい水酸基、置換基を有しているチオール基、置換基を有しているスルホニル基等、または式:



で示される基であり、

$R^{11}$ は置換基を有しているカルボニル基または置換基を有しているスルホニル基を表し、 $R^{12}$ は水素原子または置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^2$ は水素原子等を表し、Zは酸素原子または $-N(R^3)-$ で示される基を表し、 $R^3$ は置換基を有していてもよいアルキル基等を表し、 $R^{4a}$ は置換基を有していてもよいアルキル基を表し、 $R^{4b}$ は置換基を有していてもよいアルキル基を表す、

で示される、優れたタキキニン受容体拮抗活性を有する新規ピペリジン化合物またはその薬理的に許容しうる塩を提供する。